

Список литературы

- 1 Akhtar J., Khan A. A., Ali Z. *et al.* Structure-activity relationship (SAR) study and design strategies of nitrogen-containing heterocyclic moieties for their anticancer activities // Eur. J. Med. Chem. 2017. Vol. 125. P. 143–189.
- 2 Liu J.-J., Zhao M., Zhang X. *et al.* Pyrazole Derivatives as Antitumor, Anti-Inflammatory and Antibacterial Agents // Mini-Reviews Med. Chem. 2013. Vol. 13. P. 1957–1966.
- 3 Raffa D., Maggio B., Raimondi M. V. *et al.* Recent advanced in bioactive systems containing pyrazole fused with a five membered heterocycle // Eur. J. Med. Chem. 2015. Vol. 97. P. 732–746.
- 4 Agafonova N., Shchegolkov E., Burgart Y. *et al.* Synthesis and Biological Evaluation of Polyfluoroalkylated Antipyrines and their Isomeric O-Methylpyrazoles // Med. Chem. (Los. Angeles). 2019. Vol. 15. P. 521–536.

**Работа выполнена при поддержке гранта РФФ 16-13-10255 и государственного задания АААА-А19-119012490007-8.*

УДК 547.856

**Ю. А. Азев, О. С. Коптяева, О. С. Ельцов,
Ю. А. Яковлева, А. Н. Цмокалюк, А. В. Ивойлова,
Е. А. Селиверстова, Т. А. Пospelова, В. А. Бакулев**

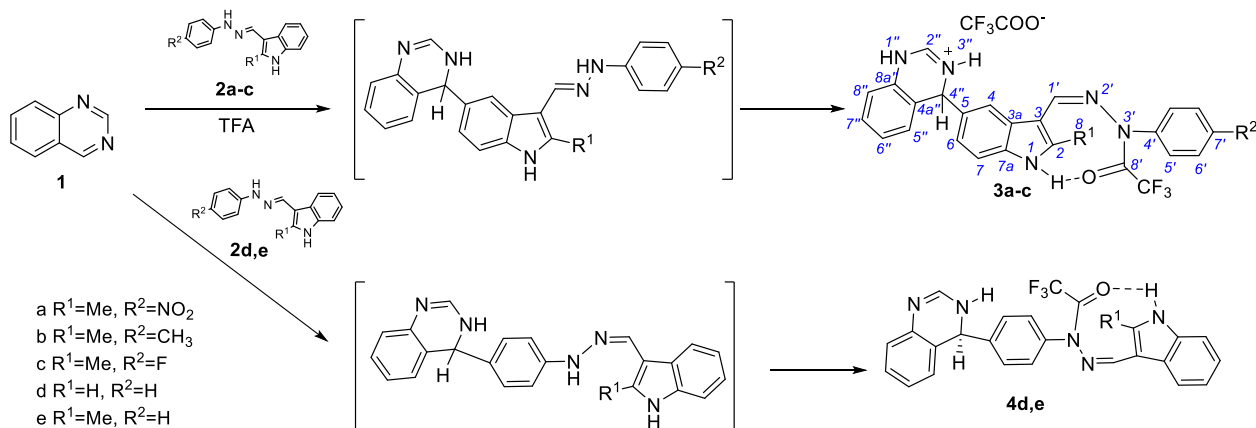
*Уральский федеральный университет
им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,
620078, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 28,
azural@yandex.ru*

АРИЛГИДРАЗОНЫ ИНДОЛКАРБАЛЬДЕГИДОВ КАК МНОГОЦЕНТРОВЫЕ С-НУКЛЕОФИЛЫ В СИНТЕЗЕ ТРИФТОРАЦЕТИЛЬНЫХ ГИДРАЗИДОВ ХИНАЗОЛИНА*

Ключевые слова: 3-карбальдегиды индола, гидразоны, азины, С,С-сочетание, кислотно-основный катализ.

Изучение вариантов С,С-сочетания гидразонов индолкарбальдегидов с азинами является перспективным путем создания мультитаргетных лекарственных препаратов. Молекулы индола содержат два выраженных С-нуклеофильных центра (C^2 и C^3), которые позволяют вступать в реакции сочетания с широким рядом гетероциклических электрофилов. В то же время взаимодействия с участием С-нуклеофильных центров бензольного фрагмента индолов в литературе не описаны.

Нами обнаружено, что при нагревании хиnazолина **1** с гидразонами **2a-c** в трифторуксусной кислоте (TFA) образуются трифторацетогидразиды аддуктов **3a-c**. Гидразоны **2d,e**, не содержащие заместителей в арильном остатке молекулы, присоединяются к хиnazолину **1** в TFA по нуклеофильному центру C^{7'} арильного фрагмента с образованием аддуктов **4d,e**.



Наличие в спектрах ЯМР 2D ¹H-¹³C gHMBC аддуктов **3a-c** и **4d,e** в ДМСО интенсивных кросс-пиков взаимодействия между кватерном углерода трифторацетильной C=O группы и протоном NH-группы индольного ядра подтверждает существование внутримолекулярной водородной связи между этими фрагментами (рис. 1).

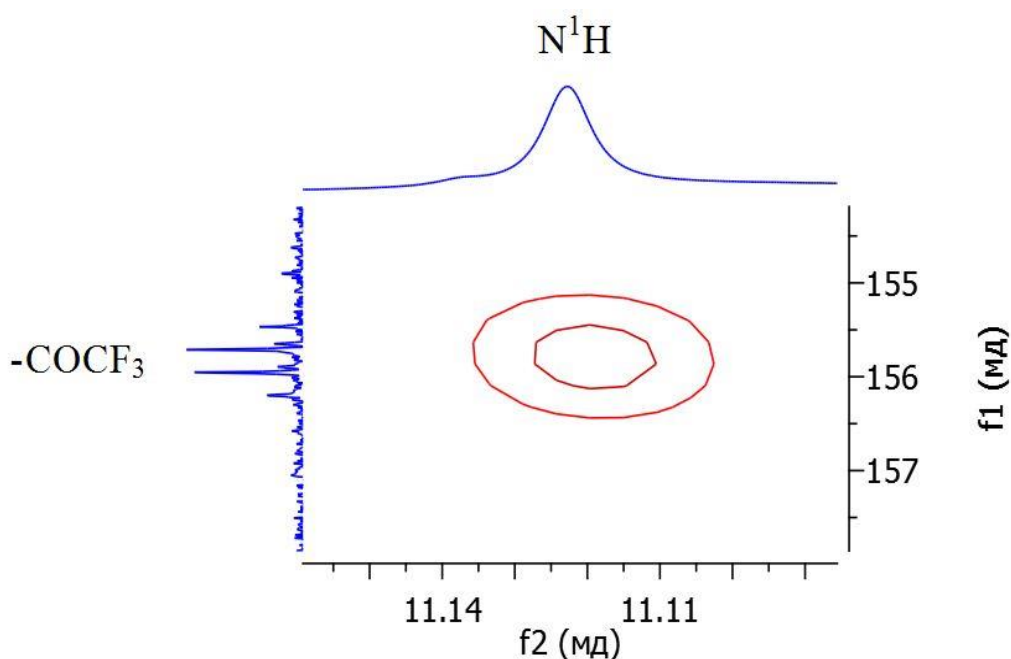
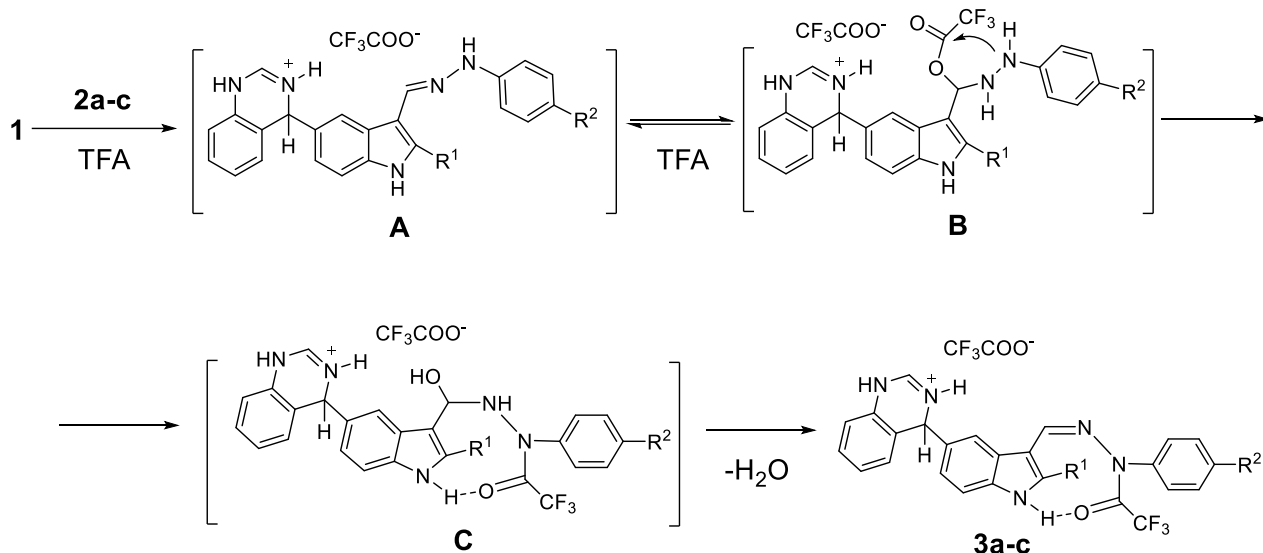


Рисунок 1. Фрагмент спектра ЯМР 2D ¹H-¹³C HMBC соединения **3a**

Интересно, что обнаруженная многокомпонентная реакция C,C-сочетания сопровождается изменением *E*-конфигурации C=N связи гидразонов **2** на *Z*-конфигурацию для гидразидов **3**.



a $R^1=Me$, $R^2=NO_2$; **b** $R^1=Me$, $R^2=CH_3$; **c** $R^1=Me$, $R^2=F$

Ацилирование хиназолина **1**, по-видимому, происходит через стадии C,C-сочетания гидразонов **2** с хиназолином **1** (интермедиаты **A**), присоединения TFA по C=N связи (интермедиаты **B**), перегруппировки **B** в N-ацетильные интермедиаты **C** и их дегидратации до гидразидов **3**.

* Работа была выполнена при финансовой поддержке РФФИ (грант № 18-33-00727 мол_а).

УДК 547.759.6

**А. С. Антонова, К. Б. Полянский, М. В. Винокурова,
П. А. Кумандин, Ф. И. Зубков**

*Российский университет дружбы народов,
Кафедра органической химии,
117198, Россия, г. Москва, ул. Миклухо-Маклая, 6,
fzubkov@sci.pfu.edu.ru*

НОВЫЕ РУТЕНИЕВЫЕ КАТАЛИЗАТОРЫ ТИПА ХОВЕЙДА-ГРАББСА В СИНТЕЗЕ СИСТЕМЫ ЦИКЛОПЕНТА[*b*]ФУРО[2,3-*c*]ПИРРОЛА*

Ключевые слова: метатезис олефинов, цикlopента[*b*]фуоро[2,3-*c*]пирролы, катализаторы Ховейда-Граббса.

Метатезис с перегруппировкой цикла (ring-rearrangement metathesis, RRM) является атом-экономичным и наиболее эффективным путём синтеза новых полициклических систем, недоступных иными путями.